

1982 年 新 药 (上)

Daniel A. Hussar (美国、费城药学和科学学院教授、系主任)

食品药品监督管理局连续第二年批准了创记录数字的新分子实体。1982年共批准了28种新药,比1981年还多出一种。在表1、表2中对28种新药中23种的治疗用途加以标明,同时列出由FDA1981年批准但直到1982年才实际上市的6种治疗药。1982年批准的其他5种新药是诊断用药,本文未加讨论。

1982年上市的新药* (表1)

一般名	商品名	制药厂	治疗分类	剂型	FDA 分类**
Acyclovir ¹	Zovirax	Burroughs Wellcome	抗病毒药	软膏剂 注射剂	1—B ¹
Azlocillin	Azlin	Miles	抗生素	注射剂	1—C
苯恶布咯 ²	Oraflex	Lilly	消炎药	片剂	1—C
头孢哌酮	Cefobid	Roerig	抗生素	注射剂	1—C
木瓜凝乳蛋白酶	Chymodiactin	Smith	腰椎间盘 突出用药	注射剂	1—C
二氟苯水杨酸	Dolobid	Merk Sharp & Dohme	镇痛/抗炎药	片剂	1—C
盐酸硫氮草酮	Cardizem	Marion	抗心绞痛药	片剂	1—C
雌二醇氮芥磷 酸钠 ³	Emcyt	Roche	抗肿瘤药	胶囊	1—C
Gemfibrozil ³	Lopid	parke-Davis	降血脂药	胶囊	1—C
氯压胍醋酸盐	Wyntensin	Wyeth	抗高血压药	片剂	1—C
13顺维甲酸	Accutane	Roche	痤疮用药	胶囊	1—C
马拉硫磷	Prioderm	Purdue Frederick	灭虱药	洗剂	1—C
氯硝柳胺	Niclocide	Miles	驱肠虫药	片剂	1—B
硝苯吡啶 ³	Procardia	Pfizer	抗心绞痛药	胶囊	1—B
吲哚心安	Visken	Sandoz	抗高血压药	片剂	1—C
氧哌嗪青霉素	Pipracil	Lederle	抗生素	注射剂	1—B
炎痛喜康	Feldene	Pfizer	消炎药	胶囊	1—C
链脲菌素	Zanosar	Upjohn	抗肿瘤药	注射剂	1—C
磺胺邻二甲氧嘧 啶/乙胺嘧啶	Fansidar	Roche	抗疟药	片剂	1,4-B
盐酸氯哌三唑酮 ³	Desyrel	Mead Johnson	抗抑郁药	片剂	1—C

注：1.本品开始批准的是归为1—B类的软膏剂。随后批准的注射剂划为3—A类（表示为重要治疗药物的一种新剂型）。

2.已从市场撤消。

3.1981年已被FDA批准，直到1982年才上市。

• 除了新治疗药外，FDA还批准了5种作为诊断药使用新药。

• • FDA新药分类：

I表示为新分子实体；A代表具有重要疗效者；B代表具有中等疗效者；C代表疗效较弱或无疗效者。

F D A 批准的其他治疗药 (表2)

1982年FDA批准了下列治疗药，但在该年底前实际上并未出现于市场上，故它们没有包括在本文中。

一般名	商品名	制造厂	治疗分类	FDA分类
Alclometasone dipropionate	Varderm	Schering	局部用甾体化合物	1—C
环己吡酮	Loprox	Hoechst—Roussel	抗真菌药	1—C
硝酸益康唑	Spectazole	Ortho	抗真菌药	1—C
甲苄咪酯	Amidate Hypnomidate	Abbott Janssen	全身麻醉药	1—C
硫酸胍环定	Hylorel	Upjohn	降压药	1—C
生物合成人胰岛素	Humulin	Lilly	降糖药	1—C
环吡异喹酮	Bitricide	Miles	抗吸血虫剂	1—A
磷酸纤维素钠	Calcibind	Univ. of Texas	高钙尿用药	1—A
三唑苯二氮卓	Halcion	Upjohn	催眠药	1—C

本评述只涉及1982年间在美国首次上市的新药。如同1981年一样，抗感染药（7种）和心血管药物（5种）列在新药表之首位。

其中2种新药——13—顺维甲酸（Isotretinoin，适于囊性痤疮）和木瓜凝乳蛋白酶（Chymopapain，批准用于腰椎间盘突出），被评为FDA的1—A类药物，即属于一种具有重要疗效的新分子实体。抗病毒药Acylovir列入1—B类以软膏剂首先上市，意味着是一种中等治疗药物，然而在1982年末它的注射剂型批准，却成为重要治疗药物。除Acylovir以外，其他5种药物——二氟苯水杨酸、氯硝柳胺、硝苯吡啶、氧哌嗪青霉素和磺胺邻二甲氧嘧啶/乙胺嘧啶均评为1—B类。

虽然其他新药（列为1—C类者疗效较弱或无疗效）的性质在许多方面类似于业已上市

的药物，但在有选择的情况下某些新药是有一定的优点。

本文介绍这些新药的最重要性质，如可能，就市售活性最相似的其他药物加以比较。对以前上市药物批准了新适应症和处方者亦予提及。

对这些药物的讨论不准备包罗万象，如果需要更详尽的情报时，可查阅综合性参考文献和产品资料。

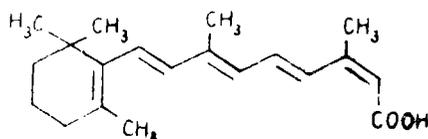
1—A类药物

痤疮用药

13-顺维甲酸(Isotretinoin, 商品名Accutane, 药厂Roche) 又称13-顺式视黄酸与视黄酸(tretinoin 维生素A酸) 有密切关系。口服给药可抑制皮脂腺的分泌, 减少皮脂的产生, 因而很快地被认为是严重而难治的囊性痤疮的最有效的治疗剂。

本品对常规治疗(包括全身抗菌素如四环素治疗) 无效的许多病人, 可达到完全的和长期的缓解。虽然本品对治疗痤疮类药物是一个重要的补充, 但对其他药物无效的严重囊性痤疮病人来说, 由于使用后不良反应的发生率和性质, 本品应作为保留用药。

本品最常见的副作用是唇炎(发炎、脱皮、和唇裂), 90%以上病人可出现这一症状。在80%的病人可见到如皮肤干燥、瘙痒、轻微鼻出血的鼻干燥及口干等反应, 并约有接受本品病人的40%发生结膜炎。



局部涂擦润滑脂可能有助于减轻干燥症, 而皮质甾醇类或抗生素眼膏对治疗结膜炎是有益的。应该告诉病人: 使用本品治疗时, 平常用于治疗痤疮的干燥剂和脱屑剂即不必用了, 否则可使脸部皮肤“过份干燥”。

其他不良反应包括肌肉骨骼的症状(16%)、皮疹、头发暂时稀疏、手掌和足底脱皮、疲劳、头痛和增加日晒的敏感性。

大约25%病人可出现血浆三硝酸甘油酯浓度增高。虽然停药治疗时此作用可逆转, 但建议在禁食情况下于治疗前和治疗后进行血脂测定。对那些有发生心血管并发症高度危险的病人尤应谨慎。本品可增高红细胞沉降率(40%的病人)和血小板计数(13%)已有报道。

本品经动物研究已观察到致畸性, 因此, 对孕妇或治疗期间就要怀孕的病人是禁忌的。育龄妇女服用本品时, 必须采取有效的避孕措施, 并建议持续避孕1个月, 或在本品停用后直到正常月经期出现为止。

既然本品与维生素A极为类似, 应劝告病人不要服用含有维生素A的维生素补充剂, 因为会增加不良反应的严重性。

本品常用剂量为每公斤每日1~2mg(一般分2次服用), 持续服用15~20周。经此疗程多数病人的病情可以缓解。不过, 对严重痤疮的病人, 可以开始第二疗程的治疗, 但必须在第一疗程完成, 至少经过8周后才行。

